



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 03819301.9

[43] 公开日 2005 年 9 月 28 日

[11] 公开号 CN 1674861A

[22] 申请日 2003. 8. 12 [21] 申请号 03819301.9

[30] 优先权

[32] 2002. 8. 15 [33] US [31] 60/403,725

[86] 国际申请 PCT/US2003/025354 2003. 8. 12

[87] 国际公布 WO2004/016237 英 2004. 2. 26

[85] 进入国家阶段日期 2005. 2. 16

[71] 申请人 宝洁公司

地址 美国俄亥俄州

[72] 发明人 R·F·戴特 S·J·普赖斯

D·J·小怀特

[74] 专利代理机构 上海专利商标事务所有限公司

代理人 徐 迅

权利要求书 3 页 说明书 17 页

[54] 发明名称 增白牙齿的方法

[57] 摘要

本发明提供了增白人的牙齿的方法，该方法包括使用增白洁齿剂处理牙齿，并且随后，但在其后十分钟时间内，在所述牙齿上使用液体漂白产品的自承薄膜，进行至少五分钟的漂白期，优选过夜。在漂白期的最后，可用增白洁齿剂除去剩余的漂白产品，并且重复整个过程。增白洁齿剂包含表面色斑移除剂，该表面色斑移除剂选自水溶性聚磷酸盐、磷酸酯聚合物和 RDA 值大于 120 的牙齿研磨剂，该表面色斑移除剂增强增白效果。漂白产品包含牙齿漂白剂和液体载体，并且在 10s^{-1} 的剪切速率和 25°C 的温度下具有的粘度低于 $1000\text{mPa}\cdot\text{s}$ 。也提供了包括增白洁齿剂和液体漂白产品的套盒。本文的方法和套盒改善了用于在家中使用的牙齿增白效果。

1. 增白人的牙齿的方法，所述方法包括：
 - a) 用包含表面色斑移除剂的增白洁齿剂处理所述牙齿，所述表面色斑移除剂选自水溶性聚磷酸盐、磷酸酯聚合物和 RDA 值大于 120 的牙齿研磨剂；和
 - b) 随后，但在其后十五分钟的时间内，将液体漂白产品的自承薄膜施用到所述牙齿上，使所述漂白产品与所述牙齿接触至少五分钟的一段漂白时间，所述漂白产品包括：
 - i) 牙齿漂白剂；和
 - ii) 液体载体，
并且在 10s^{-1} 的剪切速率和 25°C 的温度下具有低于 $1000\text{mPa}\cdot\text{s}$ 的粘度。
2. 如权利要求 1 所述的方法，其中所述牙齿漂白剂选自过氧化物、金属亚氯酸盐、过硼酸盐、过碳酸盐、过氧酸、过硫酸盐，以及它们的组合。
3. 如权利要求 2 所述的方法，其中所述牙齿漂白剂选自过氧化氢、过碳酸钠、过氧化脲，以及它们的混合物。
4. 如前述任一项权利要求所述的方法，其中所述液体载体包括成膜聚合物，所述成膜聚合物选自硅氧烷、丙烯酸酯聚合物、聚乙二醇和纤维素衍生物，优选硅氧烷。
5. 如权利要求 4 所述的方法，其中所述成膜聚合物包括交联硅氧烷树脂。
6. 如前述任一项权利要求所述的方法，其中所述表面色斑移除剂包括水溶性的直链聚磷酸盐，所述聚磷酸盐的链长为至少 3，优选至少 6，更优选至少 10。
7. 如前述任一项权利要求所述的方法，其中通过刷洗将液体漂白产品的薄膜施用到所述牙齿上。

8. 如前述任一项权利要求所述的方法，其中使口腔软组织远离所述牙齿约三十秒至约一分钟的一段时间，以使施用的液体漂白产品的薄膜能够变干。
9. 如权利要求 8 所述的方法，其中使用唇缘牵引器或牙齿辊，优选牙齿辊，使所述口腔软组织远离所述牙齿。
10. 如前述任一项权利要求所述的方法，所述方法还包括在所述漂白时间段的最后用所述增白洁齿剂刷洗所述牙齿的步骤。
11. 如前述任一项权利要求所述的方法，其中所述漂白期为一个小时或更长时间，优选过夜。
12. 如前述任一项权利要求所述的方法，其中在三至二十八天，优选七至二十一天，更优选十四天时间内每日重复步骤 a) 和 b)。
13. 如前述任一项权利要求所述的方法，其中在用所述增白洁齿剂刷洗之后和在施用所述漂白产品之前使所述牙齿变干。
14. 牙齿增白套盒，所述牙齿增白套盒包括：
 - a) 包装的包含表面色斑移除剂的洁齿剂，所述表面色斑移除剂选自水溶性聚磷酸盐和 RDA 值大于 120 的牙齿研磨剂；
 - b) 分开包装的液体漂白产品，所述液体漂白产品包括：
 - i) 牙齿漂白剂；和
 - ii) 液体载体，
并且在 10s^{-1} 的剪切速率和 25°C 的温度下具有低于 $1000\text{mPa}\cdot\text{s}$ 的粘度。
15. 如权利要求 14 所述的套盒，所述套盒还包括用于所述液体漂白产品的涂敷器。
16. 如权利要求 14 或权利要求 15 所述的套盒，所述套盒还包括附加的元件，所述附加的元件选自唇缘牵引器、牙刷和多个牙齿辊。
17. 如权利要求 14 至 16 中任一项所述的套盒，所述套盒包括 3 至 28 个涂敷器和 3 至 28 个所述液体漂白产品的单位剂量包装。

-
18. 如权利要求 14 至 17 中任一项所述的套盒，所述套盒还包括有关如何遵循如权利要求 1 至 12 中任一项所述的牙齿增白方法的说明。

增白牙齿的方法

5 发明领域

本发明涉及通过在家中使用来改善牙齿增白效果的方法和套盒。

发明背景

许多人想要增白他们的牙齿。人们经常通过使用增白牙膏刷牙来提供
10 充分的增白效果，该方法典型使用研磨剂来除去表面的或“外来的”色
斑。市场上有许多这种类型的产品。内在的色斑（其中牙釉质本身产生色
斑）也会导致牙齿变色。在这些情况下，典型地需要进行漂白处理来提供
必要的增白。

设计由牙齿专业人员进行的专业漂白处理早已被人们所知，其中牙托
15 内的过氧化物凝胶形成使用者的牙齿形状。也通过提供一般成形的牙托使
漂白处理适于在家中使用。然而，牙托戴起来很麻烦。最近，W098/55044
中描述了牙齿增白凝胶涂敷的薄基质薄膜。目前可在市场上以 Crest
Whitestrips® 购得这种普通设计的产品。虽然所有这些处理都很有效，
但是它们都涉及佩戴某种递送装置，该装置长期使用会使人感到不舒服，
20 或者如果戴着睡觉会出现安全问题。另外它们也相当昂贵。

涂上或刷上的漂白薄膜或涂料也是已知的，例如 EP 511 782，该专利
公开了包含羟丙基纤维素和过氧化脲的水醇组合物。由 W0 97/25968 和
W0 01/01940 也已知包含硅氧烷树脂、有机溶剂和过碳酸钠的非水成膜牙
齿增白组合物。后者公开了包含硅氧烷树脂、有机溶剂和过碳酸钠的组
25 合物。这些刷子上的薄膜对于使用者进行应用是直观的，并且这些薄膜可长
时间保留，例如过夜。

漂白处理也已经在增白牙膏的上下文中提供过。例如，GB 2, 289, 841
公开了包含亚氯酸钠和菠萝蛋白酶的糊剂，并且 US 5, 814, 304 公开了包
含过氧化物的牙膏。也已经有许多两相过氧化物洁齿剂组合物的公开内
30 容，这些内容解决过氧化物与其他洁齿剂组分的不相容性问题，或使用非

过氧化物相来为过氧化物提供活化剂。US 6,106,812、EP 535,816 和 WO 97/21419 是这些公开内容的代表。这些文件中公开的过氧化物不相容组分包括二氧化硅和氧化铝研磨剂、三聚磷酸钠抗牙垢剂和葡萄糖酸锰过氧化物活化剂。US 6,290,935 公开了两相组分，其中通过包含埋入铁的硅酸盐粘土的活化相来补充过氧化物相。在使用活化剂的情况下，目的通常是处理相对低含量的过氧化物，该过氧化物可稳定存储并且可用于这些在家中使用的组合物。

涉及两相组合物的这些文件通常提出将组分共同分配到刷子上，并且在刷牙时混合在一起。US 6,174,516 描述了顺序处理，其中通过首先使用碱性液漱洗牙齿，然后不经水洗就用过氧化脲洁齿剂刷牙，来获得提高的牙齿增白。US 5,122,635 描述了三部分的顺序处理：使用乙酸的调理漱口水来除去表膜，使用过氧化物凝胶一至四分钟然后漱洗，最后用磨光霜膏和颜料霜膏刷洗，目的是既摩擦牙齿又遮蔽剩余的变色。

尽管前述所有的内容，仍然需要便宜的、易于使用的牙齿增白体系，该体系提供高度的有效性。因此，本发明的目的是提供牙齿增白疗法，该疗法易于遵循，并且提供比已知涂上或刷上的产品更强的有效性。本发明的另一个目的是提供具有增强功效的牙齿增白疗法，该疗法通过与使用者的正常牙齿卫生实践一致来鼓励使用者的顺从性。本发明的另一个目的是提供适合与此方法一起使用的套盒。

通过后面的详细描述，这些和其他目的将变得显而易见。

所有引用的文献的相关部分均引入本文以供参考，任何文献的引用不可解释为是对其作为本发明的现有技术的认可。

发明概述

本发明提供了增白人的牙齿的方法，该方法包括使用洁齿剂处理牙齿，并且随后，但在其后十分钟时间内，对所述牙齿使用液体漂白产品的自承薄膜，进行至少五分钟的漂白期，优选过夜。在漂白期的最后，可用增白洁齿剂帮助除去剩余的漂白产品，并且重复整个过程。增白洁齿剂包含表面色斑移除剂，该表面色斑移除剂选自水溶性聚磷酸盐、磷酸酯聚合物和 RDA 值大于 120 的牙齿研磨剂，该表面色斑移除剂增强增白效果。漂

白产品包含牙齿漂白剂和液体载体，并且在 10s^{-1} 的剪切速率和 25°C 的温度下具有小于 $1000\text{mPa}\cdot\text{s}$ 的粘度。

也提供了包括增白洁齿剂和液体漂白产品的套盒。本文的方法和套盒改善了用于在家中使用的牙齿增白效果，并且提供了适合使用者正常牙齿卫生实践的方便的长期疗法。

发明详述

除非另外指明，本文所有百分比和比率均以重量计，并且都是在 25°C 测定的。除非另外指明，本文所有粘度都是在 25°C 和 10s^{-1} 的剪切速率下使用稳态流方法测定的。用于此目的合适量度仪器是 TA 仪器 AR2000，该仪器可由 TA Instruments, New Castle, Delaware, USA 提供。

增白洁齿剂

增白洁齿剂用于在使用液体漂白产品前处理牙齿。处理一般是指将少量洁齿剂分配到常用的牙刷上，然后刷洗所有的牙齿表面，持续时间一般为约三十秒至约两分钟。通常可期望使用者，即其牙齿被增白的人，在处理

的最后吐出洁齿剂，并且通常用水漱口。

除非另外指明，本文所用术语“洁齿剂”是指糊剂、凝胶或液体制剂。增白洁齿剂是常规形式的，例如糊剂或凝胶，并且可以是单相、两相或多相制剂。所谓“相”是指洁齿剂被分开包装或填充的部分，例如管中的条状物。单相可包括含有一种或多种不溶解颗粒的液体载体，例如含有在其中均一或均匀分散的牙齿研磨剂。以常规方式用洁齿剂处理牙齿，典型地通过在牙刷上应用常规量，随后通过用洁齿剂刷牙几秒钟至约两分钟的时间，然后吐出和/或用水漱口。

本文增白洁齿剂的基本组分是表面色斑移除剂，该表面色斑移除剂选自水溶性聚磷酸盐、磷酸酯聚合物和 RDA 值大于 120 的牙齿研磨剂。这些组分在处理过程中提供有效的色斑移除，并且尤其是用本文的长链聚磷酸盐和磷酸酯聚合物时，提供某种表面残余物。据信，该残余使它们能够为随后应用的漂白产品提供活化效果。所选的表面色斑移除剂在刷牙后进一步提供牙齿光滑的、平滑的感觉，该感觉增强了整个使用体验，并且用漂

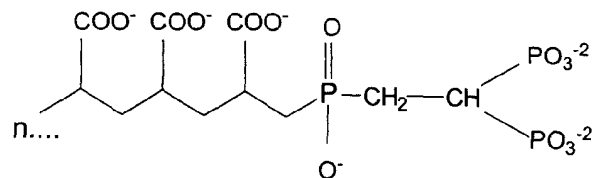
白产品为牙齿表面准备了平滑的涂层。水溶性聚磷酸盐和磷酸酯聚合物是优选的表面色斑去除剂，并且它们可以掺合物使用。

5 优选种类的表面色斑去除剂是水溶性聚磷酸盐。可用于本发明的水溶性聚磷酸盐由三种或多种磷酸盐分子组成，它们主要以直链构型排列，尽管也可存在某些环状的衍生物。本文优选的聚磷酸盐是链长度至少为 6，更优选为至少 10 的那些，典型地作为它们的完全中和的碱金属盐的形式存在。除了其他的以外，聚磷酸盐包括四聚磷酸盐和六偏磷酸盐。比四聚磷酸盐大的聚磷酸盐通常以无定形玻璃质材料出现。本发明优选的是符合化学式 $XO(XPO_3)_nX$ 的直链的“象玻璃的”聚磷酸盐，其中 X 是钠或钾，
10 并且 n 平均为约 6 至约 125。合适的聚磷酸盐以 Sodaphos (n ~ 6)、Hexaphos (n ~ 13) 和 Glass H (n ~ 21) 市售自 Astaris, LLC, Creve Coeur IV, 622 Emerson Road, St. Louis, Missouri 63141。这些聚磷酸盐可单独使用或以它们的任何组合使用。

另一种优选种类的表面色斑去除剂是磷酸酯聚合物，尤其是磷酸酯共聚物。
15 磷酸酯共聚物的实施例是在授予 Benedict 等人的美国专利 5,011,913 中的二磷酸酯衍生聚合物。优选的聚合物是二磷酸酯改性的聚丙烯酸。如下所示的合适的包含磷酸酯的聚合物描述于授予 Zakikhani 等人的美国专利 5,980,776。

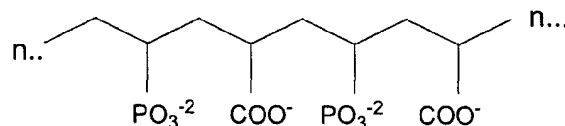
1. 具有以下结构的丙烯酸和二磷酸的共聚物：

20

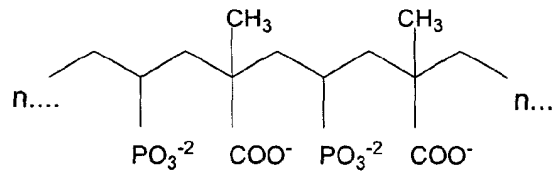


2. 具有以下结构的丙烯酸和乙烯磷酸的共聚物：

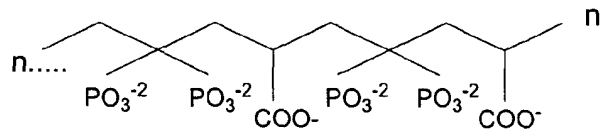
25



3. 具有以下结构的甲基丙烯酸和乙烯膦酸的共聚物:



5 4. 具有以下结构的丙烯酸和乙烯基二膦酸的共聚物:



本文可供选择的表面色斑去除剂是 RDA (放射性牙质磨损) 值大于
 10 120, 优选 130 至 250, 更优选约 150 至约 200 的牙齿研磨剂。放射性牙质
 磨损是当掺入洁齿剂中时, 研磨剂的磨损性的量度。RDA 值根据由下述文
 献提出的方法测定: Hefferren, Journal of Dental Research, July-
 August 1976, 第 563 至 573 页, 和 Wason 的美国专利序列号 4, 340, 583,
 4, 420, 312 和 4, 421, 527。研磨剂的优选粒径平均值在约 5 至约 15 微
 15 米, 优选约 8 至约 12 微米范围内。用购自 Leeds 和 Northrup 的
 Microtrac II 颗粒分析仪器测量粒径平均值。具体地讲, 将激光光束投影
 穿过包含一股悬浮在液体中的移动颗粒的透明小室。触及颗粒的光线通过
 与其大小成反比例的角度散射。光电探测器阵列以几个预先确定的角度测
 量光的量。与被测光通量值成比例的电信号然后用微机系统处理, 形成粒
 20 径分布的多通道柱状图。

可用于本发明的化学类型的研磨剂可以是本领域常规的那些, 例如二
 氧化硅和氧化铝。优选的是沉淀二氧化硅, 特别是具有良好氟化物相容性
 的那些二氧化硅, 具体地讲与氟化钠和氟化亚锡来源的氟相容。

本发明优选的沉淀二氧化硅是根据下述文献所提出定义的低级结构的
 25 二氧化硅: J. Soc. Cosmet. Chem. 29, 第 497 至 521 页 (1978 年 8 月),
 和 Pigment Handbook: 第 1 卷, Properties and Economics, 第二版,

Peter A. Lewis 编, John Wiley & Sons, Inc., 1988, 第 139 至 159 页。

也可使用聚磷酸盐和牙齿研磨剂的混合物。表面色斑移除剂的有用量在占洁齿剂低至约 0.1% 至最高约 50% 的范围内变化。优选的量为占洁齿剂的约 5% 至最高约 35%, 并且更优选约 15% 至最高约 30%。尽管还没有完全理解机理, 据信, 通过液体漂白产品的牙齿漂白剂的活化, 至少部分获得有益效果, 该活化是通过表面色斑移除剂粘附或吸附在牙齿表面进行的。

任选洁齿剂成分包括下列物质, 例如表面活性剂、氟离子来源、附加的抗牙结石剂、缓冲剂、其他磨料、增稠物质、湿润剂、水、调味剂、甜味剂、木糖醇、着色剂, 以及它们的混合物。

本发明的洁齿剂优选的任选剂之一是表面活性剂。存在于本发明洁齿剂中的表面活性剂的含量按所述洁齿剂的重量计可以为约 0.1% 至约 2.5%, 优选约 0.3% 至约 2.5%, 且最优选约 0.5% 至约 2.0%。有用的表面活性剂类型包括阴离子、非离子和甜菜碱表面活性剂。也可使用阳离子表面活性剂, 但一定要注意它们与其他典型的洁齿剂成分的相容性。

可用于本发明的优选阴离子表面活性剂包括其烷基含有 10 至 18 个碳原子的水溶性烷基硫酸盐, 和含有 10 至 18 个碳原子的脂肪酸的磺化单酸甘油酯的水溶性盐。这类阴离子表面活性剂的实施例是月桂基硫酸钠和椰子基单酸甘油酯磺酸钠。也可用于本发明的是肌氨酸盐表面活性剂、羟乙基磺酸盐表面活性剂和牛磺酸盐表面活性剂, 例如月桂酰肌氨酸盐、肉豆蔻酰肌氨酸盐、棕榈酰肌氨酸盐、硬脂酰肌氨酸盐和油酰肌氨酸盐。所有前述的物质通常以它们的碱金属盐或铵盐使用。

合适的非离子表面活性剂的实施例包括聚丙二醇与环氧乙烷的加聚物(聚醚)、烷基酚的聚环氧乙烷缩合物、衍生自环氧乙烷与氧化丙烯和 1,2-乙二胺的反应产物的缩合产物、脂族醇的环氧乙烷缩合物、长链叔胺氧化物、长链叔磷氧化物、长链二烷基亚砷, 以及这些物质的混合物。

优选的甜菜碱表面活性剂公开于 1993 年 1 月 19 日公布的授予 Polefka 等人的美国专利 5,180,577。典型的烷基二甲基甜菜碱包括癸基甜菜碱或 2-(N-癸基-N,N-二甲基铵基)乙酸酯、椰油基甜菜碱或 2-(N-椰

油基-N,N-二甲基铵基) 乙酸酯、十四烷基甜菜碱、棕榈基甜菜碱、月桂基甜菜碱、鲸蜡基甜菜碱、硬脂基甜菜碱等。酰氨基甜菜碱的实施例有椰油酰氨基乙基甜菜碱、椰油酰氨基丙基甜菜碱、月桂酰氨基丙基甜菜碱等。选择的甜菜碱优选为椰油酰氨基丙基甜菜碱，并且更优选为月桂酰氨基丙基甜菜碱。

5 另一种优选的任选剂是螯合剂。螯合剂能络合存在于细菌细胞壁中的钙。螯合剂也可以通过从钙桥中除去钙来分解牙斑，这有助于保持生物物质完整。优选的螯合剂具有的钙结合常数为约 10^1 至 10^5 ，以减少牙斑和牙结石的形成，从而提供改善的清洁。

10 本文有用的螯合剂包括酒石酸和它们可药用的盐、柠檬酸和柠檬酸碱金属盐，以及它们的混合物。柠檬酸钠和柠檬酸钾是优选的柠檬酸碱金属盐，最优选柠檬酸钠。还优选的是柠檬酸/柠檬酸碱金属盐组合物。本文优选的是酒石酸的碱金属盐。最优选用于本发明的是酒石酸二钠、酒石酸二钾、酒石酸钾钠、酒石酸氢钠和酒石酸氢钾。适用于本发明洁齿剂的螯合剂的量为约 0.1% 至约 2.5%，优选约 0.5% 至约 2.5%，且更优选约 1.0% 至约 2.5%。酒石酸盐螯合剂可以单独使用或与其他任选螯合剂组合使用。

适合作为本发明的螯合剂使用的另一类试剂是可溶解的焦磷酸盐。用于本发明组合物的焦磷酸盐可以是任何焦磷酸碱金属盐。具体的焦磷酸碱金属盐包括焦磷酸四碱金属盐、焦磷酸二氢二碱金属盐、焦磷酸一氢三碱金属盐，以及它们的混合物，其中碱金属优选为钠或钾。这些盐可以以其水合形式和未水合形式使用。用于本发明组合物的有效量的焦磷酸盐通常足以提供至少 1.0% 焦磷酸根离子，优选约 1.5% 至约 6%，更优选约 3.5% 至约 6% 的这些离子。应当理解，焦磷酸根离子的含量即能够提供给组合物的量(即适当 pH 下的理论量)，并且当最终产物的 pH 确定时，可以存在 20 不同于 $P_2O_7^{4-}$ (例如， $(HP_2O_7)^{3-}$) 的焦磷酸盐形式。

还适用于洁齿剂的其他可能种类的螯合剂是阴离子聚合的聚羧酸酯。这些物质是本领域众所周知的，它们以其游离酸、或部分或优选完全中和的水溶性碱金属(例如钾，且优选钠)盐或铵盐的形式应用。优选的是 1:4 至 4:1 的马来酸酐或酸与另一种可聚合的烯键式不饱和单体的共聚物，优 30 选分子量为约 30,000 至约 1,000,000 的甲基乙烯基醚(甲氧基乙烯基)。

这些共聚物可例如以 Gantrez AN 139 (M.W. 500,000)、AN 119 (M.W. 250,000), 并且优选 S-97 药品等级 (M.W. 70,000), 得自 GAF Chemicals Corporation。

5 洁齿剂中优选含有水溶性氟化物的量, 足以按重量计供给组合物的氟化物离子浓度为约 0.0025% 至约 0.5%, 以提供附加的防龋效力。多种产生氟离子的物质可用作本发明组合物的可溶解的氟化物源。代表性的氟离子源包括氟化亚锡、氟化钠、氟化钾、单氟磷酸钠和许多其他物质。尤其优选的是氟化亚锡和氟化钠, 以及它们的混合物。然而, 如果氟化钠与长链聚磷酸盐色斑移除剂联合使用, 那么优选保存在分开的相中。

10 本文的增白洁齿剂可进一步包含常规用于化妆品领域的颜料和着色剂。最优选的是选自二氧化钛、氟氧化铋、氧化锌, 以及它们的混合物的那些物质。

在制备牙膏或凝胶时, 为了提供满意的组合物稠度、提供使用时满意的活性物质释放特性、提供架藏稳定性和提供组合物稳定性等, 经常有必要加入一些增稠物质。优选的增稠剂是羧乙烯基聚合物、角叉菜胶、羟乙基纤维素、合成锂皂石以及纤维素醚的水溶性盐, 如羧甲基纤维素钠和羧甲基羟乙基纤维素钠。也可使用天然树胶 如刺梧桐树胶、黄原胶、阿拉伯树胶和黄蓍胶。优选种类的增稠剂或胶凝剂包括已知为卡波姆的丙烯酸的交联均聚物类别。卡波姆以 Carbopol® 系列市售自 B. F. Goodrich。
15 尤其优选的 Carbopol 包括 Carbopol 934、940、941、956, 以及它们的混合物。

另一种任选但优选的增白洁齿剂的局部用口腔载体组分是湿润剂。湿润剂用于防止洁齿剂在接触空气后发生硬化, 给予口腔以潮湿感, 并且特定湿润剂还可赋予理想的甜味。以纯湿润剂为基础, 该湿润剂通常占本发明洁齿剂重量的约 5% 至约 70%, 优选约 15% 至约 45%。合适的湿润剂包括可食用多元醇, 例如甘油、山梨醇、木糖醇、丁二醇、聚乙二醇和丙二醇, 特别是山梨醇和甘油。
25

也优选将调味剂和甜味剂加入洁齿剂。合适的调味剂和甜味剂是本领域熟知的。

在制备洁齿剂中使用的水应该优选是低离子含量的，并且不含有机杂质。水通常占本发明洁齿剂重量的约 10% 至约 50%，优选约 20% 至约 40%。这些水的量包括加入的游离水和由其他物质(如由山梨醇)带入的水。

- 5 通过使用缓冲剂可以将本发明组合物的 pH 调节至优选的范围，约 4.5 至约 9.5，更优选约 7 至约 8。合适的缓冲剂包括磷酸二氢钠、磷酸三钠、氢氧化钠、碳酸钠、酸式焦磷酸钠、柠檬酸和柠檬酸钠。洁齿剂的 pH 由 3:1 含水的洁齿剂浆来测量。

可用于本发明洁齿剂的其他任选试剂包括选自烷基聚二甲基硅氧烷共聚多元醇和烷氧基聚二甲基硅氧烷共聚多元醇的聚二甲基硅氧烷共聚多元醇牙斑阻断剂，如 C12 至 C20 烷基聚二甲基硅氧烷共聚多元醇，以及它们的混合物。高度优选的是以商品名 Abil EM90 市售的鲸蜡基聚二甲硅氧烷共聚多元醇。聚二甲基硅氧烷共聚多元醇也有助于提供积极的牙齿感觉有益效果。这些试剂更加详述于 W0 96/19191。

- 15 也可使用其他活性剂，例如抗微生物剂。包括在这些剂中的是水不溶性的非阳离子抗微生物剂，例如卤代二苯基醚，尤其是三氯生和精油例如百里酚。水溶性抗微生物剂包括季铵盐例如氯化十六烷基吡啶。也可包括其他抗微生物剂，如双甘氨酸铜、柠檬酸锌和乳酸锌。酶是另一类可用于本发明组合物的活性物质。有用的酶包括属于蛋白酶、溶解酶、牙斑基质抑制剂和氧化酶类的那些酶。蛋白酶包括木瓜蛋白酶、胃蛋白酶、胰蛋白酶、无花果蛋白酶、菠萝蛋白酶；细胞壁溶解酶包括溶菌酶；牙斑基质抑制剂包括葡聚酶、突变酶；且氧化酶包括葡萄糖氧化酶、乳酸盐氧化酶、半乳糖氧化酶、尿酸氧化酶；过氧化物酶包括辣根过氧化物酶、绿过氧化物酶、乳过氧化物酶、氯过氧化物酶。除了抗微生物特性之外，氧化酶还具有增白/清洁活性。这些试剂公开于 1960 年 7 月 26 日授予 Norris 等人的美国专利 2,946,725 和 1977 年 9 月 27 日授予 Gieske 等人的美国专利 4,051,234。

液体漂白产品

- 30 液体漂白产品包含牙齿漂白剂，该漂白剂需要与牙齿接触较长的一段时间，至少约五分钟，典型约三十分钟或更长时间，优选至少约一小时，

并且更优选长得多的时间，例如过夜。为了提供比较长的接触，当施用到牙齿时，该产品需要能够被用来形成自承薄膜。所谓“自承薄膜”是指保持与牙齿接触而不脱落，无需使用牙托或其他装置来使其就位的一种薄膜。为了这种目的，产品需要能够由涂敷器均匀地使用，并且因此具有的适当的低于约 1000mPa.s，优选低于约 500mPa.s，并且更优选低于约 150mPa.s 的粘度。为了使产品一旦使用即可保持在牙齿上，其优选的粘度为至少约 1mPa.s，并且更优选至少约 5mPa.s。

液体漂白产品的基本组分是牙齿漂白剂，其用来移除或漂白牙齿表面上或里面的固有的或外表的色斑。牙齿漂白剂优选选自过氧化物、金属亚氯酸盐、过硼酸盐、过碳酸盐、过氧酸、过硫酸盐，以及它们的组合。合适的过氧化物包括过氧化氢、过氧化脲、过氧化钙、过氧化脲，以及它们的混合物。合适的金属亚氯酸盐包括亚氯酸钙、亚氯酸钡、亚氯酸镁、亚氯酸锂、亚氯酸钠和亚氯酸钾。另外的漂白剂包括次氯酸盐和二氧化氯。优选的亚氯酸盐是亚氯酸钠。优选的过碳酸盐是过碳酸钠。优选的过硫酸盐是过硫酸氢钾。最优选的漂白剂是过氧化氢、过碳酸钠、过氧化脲，以及它们的混合物。所用漂白剂的含量分别部分取决于使得分子能够提供漂白色斑有效的氧或氯，但通常按所述液体漂白产品的重量计在约 0.1% 至约 35%，优选约 1% 至约 25%，并且最优选约 3% 至约 12% 的范围内变化。

漂白产品任选但高度可取的组分是成膜聚合物，该聚合物为产物提供结构，尤其是一旦处于牙齿上。本文所用术语“成膜聚合物”是指能够独自形成或在增塑剂存在时形成视觉连续薄膜（无论多孔还是无孔）的聚合物。成膜聚合物可溶解，或以颗粒形式均一分散在漂白产品的液体载体中。

许多已知的增稠剂适于此目的，例如淀粉、纤维素衍生物、聚乙二醇和例如卡波姆的丙烯酸酯聚合物。EP 511 782 公开了合适的羟丙基纤维素基产物。

成膜聚合物可进一步包括下列物质，例如聚氨酯、聚酯、醇酸树脂、环氧树脂树脂；多种硅氧烷材料例如聚硅氧烷、硅橡胶纯胶料和树脂；以及它们的混合物。优选可用于本文的是硅氧烷，它通常是水不溶性的，不太

容易从牙齿上洗掉，并且也向薄膜提供令人愉快的润滑性。尤其优选适用于本文的是有机硅氧烷树脂。

有机硅氧烷树脂是高度交联的聚硅氧烷体系。所述交联是通过在硅氧烷树脂生产期间，将三官能和四官能化硅烷与单官能或双官能化硅烷或二者一起掺入，来引入的。正如本领域所公知，为得到硅氧烷树脂所需的交联程度，将根据掺入硅氧烷树脂中的特定的硅烷单位而变化。一般情况下，如果硅氧烷材料具有足够含量的三官能和四官能硅烷单体单元，并因此具有足够水平的交联，从而使得它们在变干时可形成坚硬或坚固的膜，那么这些硅氧烷材料可视为硅氧烷树脂。氧原子与硅原子的比例是特定的硅氧烷材料交联水平的指征。每一硅原子具有至少约 1.1 个氧原子的硅氧烷材料，通常是本发明的硅氧烷树脂。优选地，氧原子与硅原子的比例为至少约 1.2:1.0。

除了上述公开的有机硅氧烷树脂之外，本发明的液体漂白产品还可进一步包括流体二有机聚硅氧烷基聚合物，来与有机硅氧烷树脂结合。

有用的流体二有机聚硅氧烷聚合物是包括重复单元的那些，其中所述单元符合化学式 $(R_2SiO)_n$ ，其中 R 是包含 1 至 6 个碳原子的一价基，优选选自甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、叔丁基、戊基、己基、乙烯基、烯丙基、环己基、氨基烷基、苯基、氟代烷基，以及它们的混合物。用于本发明的流体二有机聚硅氧烷聚合物可作为硅氧烷聚合物主链上的取代基包含这些基的一个或多个。

本文有机硅氧烷树脂和流体二有机聚硅氧烷聚合物的进一步描述，包含于 PCT 申请 WO 01/01940，该申请更加广泛地公开了可用于本文的优选液体漂白产品。

用于本发明的树脂的范围通常为约 5% 至约 70%，优选约 15% 至约 45%，并且最优选约 20% 至约 40%。

漂白产品通常包含溶剂来赋予产品所需的流动性，并且提供结构的均匀性。包含的溶剂通常占所述液体漂白产品的约 10% 至约 90%，优选约 15% 至约 80%，并且更优选约 20% 至约 70%。溶剂可以是水、醇或水醇混合物。对于某些聚合物例如上文所述的硅氧烷，有机溶剂更合适。

优选的有机溶剂具有的沸点低于约 150°C，优选低于约 100°C，并且具有的溶解度参数低于约 22 (MPa)^{0.5}。溶解度参数是本领域所熟知的，并且很容易从表中查到，本文所用的那些是得自 Barton 的 *Handbook of Solubility Parameters*, CRC Press, 1983 的 SI Hildebrand 值。有机溶剂
5 剂优选选自烃油、挥发性的硅氧烷、非烃溶剂，以及它们的混合物。

可用于本发明的烃油包括沸点在 60°C 到 150°C 范围内的那些，更优选具有约 C₆ 至约 C₁₀ 链长度的烃油，最优选 C₇ 至 C₁₀ 石蜡和异链烷烃。最优选庚烷。

可用于本发明的普通种类的非烃溶剂包括沸点在 60°C 至 150°C 范围内的酯、酮、醇、碳氟化合物和碳氟化合物醚。尤其有用的非烃溶剂或它们的混合物包括能够增溶树脂和/或二有机聚硅氧烷基聚合物的那些。这些溶剂包括但不限于丁酮、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸戊酯、丁酸乙酯、
10 甲基九氟异丁基醚、甲基九氟丁基醚，以及它们的混合物。

优选的有机溶剂是选自下列的那些物质：乙酸乙酯、2-丁酮和庚烷，
15 更优选 2-丁酮（甲基乙基酮）。可根据需要使用另外的溶剂。

液体处理产品可进一步包括其他活性剂和辅剂，例如结构化试剂、螯合剂、稳定剂、填充剂、调味剂等等。以与本文的聚合物和树脂的相容性为条件，可使用范围广阔的活性剂，包括口腔和皮肤护理有益剂。合适的活性剂包括牙齿颜色改变物质例如颜料；抗牙垢剂例如聚磷酸盐；氟离子
20 来源例如氟化钠；抗微生物剂例如三氯生；抗炎剂例如氟比洛芬或萘普生；营养物质例如锌和维生素；抗氧化剂例如抗坏血酸；H₂ 受体拮抗剂化合物例如西咪替丁和雷尼替丁；脱敏剂例如硝酸钾；以及抗滤过性毒菌活性物质例如无机亚锡卤化物。这些活性物质的更完整列表存在于 PCT 公开
WO 01/01940。

液体漂白产品可包装在任何合适的保护包装中，例如用于为整个治疗期提供足够产品的瓶子，但方便地以单位剂量、一次性的层压材料包装提供。对于本文的有机溶剂，合适的层压材料包括铝隔离层和聚合物接触层，该聚合物选自聚丙烯、聚酰亚胺和尼龙 12。单位剂量包装可包括任何
30 合适的形式，例如小药囊、可剥落泡和撕开泡。优选用于一次性包装的包装形式是具有一个纵向密封和两个横向密封的三密封小药囊。优选提供在

伸入横向密封之一具有撕开凹口的三密封小药囊。PCT 专利申请 WO 95/01921 描述了合适的三密封小药囊。考虑所需的任何顶部空间，包装按容纳形成单位剂量所需量的液体漂白产品的尺寸制造。合适体积的液体漂白产品为约 0.1ml 至约 10ml，优选约 0.2ml 至约 2ml，更优选约 5 0.2ml 至约 1ml。

使用方法

在第一方面，本发明进一步涉及增白人的牙齿的方法，该方法包括用本文描述的增白洁齿剂处理牙齿，并且随后，但在约十五分钟时间内，优选其后约五分钟期间，将液体漂白产品的自承薄膜施用到牙齿，并且将漂
10 白产品留下与牙齿接触至少五分钟的漂白期。可在用洁齿剂处理后漱口。漂白期优选至少约三十分钟，更优选至少约一小时或更长，并且更优选几个小时，例如过夜。据发现，如果在用增白洁齿剂处理后并且在施用漂白产品之前弄干牙齿，更容易施用漂白产品。通过用软牙刷刷牙可方便地将漂白产品施用到牙齿上。为了避免将施用的液体漂白产品的薄膜擦到口腔
15 软组织上，例如唇缘、舌和颊面上，尤其是唇缘和舌上，通常必需让那些组织远离牙齿至薄膜干燥。通常约三十秒至约一分钟的时间就够。在这个方面，当施用液体漂白产品时，使用如描述于 PCT 出版物 WO/02/07636 的唇缘牵引器来使唇缘退缩会有帮助。放置在唇缘和齿龈之间的牙齿辊也有帮助，并且具有当漂白产品薄膜干燥时使唾液远离所处理牙齿表面的增加
20 的优势。在漂白期的最后，可再用洁齿剂刷牙，来除去剩余的薄膜和破碎的污渍。

上文所述方法旨在用于长期的治疗，并且优选在每日基础上重复约三至约二十八天，优选约七至二十一天，更优选十四天。方便的疗法是让使用者在晚上上床前用平常的方式用增白洁齿剂清洁牙齿，然后在漱洗和干燥
25 牙齿后施用该液体漂白产品。在留出短时间让漂白产品干燥之后，使用者然后可去睡觉，并且在早上再用增白洁齿剂刷牙。如果需要，这时也可进一步施用漂白产品。在几天内就可看到显而易见的增白改进，但两周或更多天可能会更适合许多人。如何遵循所需方法的用法说明通常包括在提供适当材料的套盒中。

套盒

本发明也提供套盒，该套盒包括本文所述的包装的洁齿剂，和分开包装的本文所述的液体漂白产品。套盒优选包括至少一个用于液体漂白产品的涂敷器，并且优选多个涂敷器，因为一个涂敷器用过后会被干燥的漂白产品粘附，而不适合再使用。涂敷器可包括具有细长柄部的刷子或与可重复使用的柄部一起使用的可置换刷子部分。海绵或药签可也取代刷子。在一个优选的实施方案中，套盒包括单位剂量形式的漂白产品，其中“单位剂量”是指恰好足够用于一次施用此方法的产品。套盒优选每单位剂量产品包括一个涂敷器，并且一个套盒中提供的涂敷器和单位剂量产品的数目可在约 3 至约 28 个的范围内变化。最优选套盒包括十四个涂敷器和十四个单位剂量产品，以配合两周的每日使用疗法。本文的套盒可进一步包括选自下列的额外元件：唇缘牵引器、牙刷和多个牙齿辊，并且通常包装在印刷的装入所有这些套盒元件的外部硬纸盒里。可在外部硬纸盒上印刷方法细节，以帮助消费者在购买前估定它的适宜性。

实施例

下表列出了可用于本发明的有代表性的增白洁齿剂产品的配方。洁齿剂包括两相，它们以等量包装在合适容器的分开隔室中，并且以两股共同分配。具体地讲，洁齿剂的两相状态使得聚磷酸钠稳定地储存，而不会有氟化物引发水解的风险。

成分	A相 重量百分比(%)	B相 重量百分比(%)
甘油	42.7	30.0
氟化钠	0.00	0.64
聚磷酸钠	14.0	0.0
沉淀二氧化硅	24.0	20.0
烷基硫酸钠	1.12	0.56
黄原胶	0.20	0.10
聚乙二醇 300	6.66	-
聚乙二醇 600	2.00	-

二氧化钛	0.50	-
调味剂	1.10	1.10
糖精钠	0.40	0.40
羧甲基纤维素钠	0.10	-
泊洛沙姆 407	0.50	-
PEG 20M	0.50	-
山梨醇	-	21.5
椰油酰氨基丙基甜菜碱	-	0.87
卡波姆	-	1.00
氢氧化钠	-	0.80
FD&C 蓝色#1	-	0.003
水	至 100%	至 100%

对于可供选择的包括二氧化硅色斑去除剂的单相增白洁齿剂，配方列出如下：

材料	%
山梨醇溶液(70%) USP	24.96
二氧化硅--Zeodent 109 ¹	15.0
二氧化硅--Zeodent 118 ²	15.0
增稠的二氧化硅	1.0
甘油	7.75
聚乙二醇 300, nf (peg-6)	6.0
无水焦磷酸四钠	5.0
烷基钠溶液(27.9%)	5.0
碳酸氢钠	1.5
泊洛沙姆 407, NF	1.25
风味剂	1.1
二氧化钛/卡洛巴蜡颗粒	1.0
羧甲基纤维素钠	0.75

糖精钠	0.35
无水碳酸钠	0.50
氟化钠	0.24
颜色	0.05
纯化的 USP 等级的水	至 100%

1. RDA 大于 130 的得自 Huber 的沉淀二氧化硅
2. RDA 为 87 的得自 Huber 的沉淀二氧化硅

下表列出了可用于本发明的有代表性的液体漂白产品的配方。其他有代表性的液体处理产品公开于 PCT 出版物 WO 01/01940。

材料	%
蓝色颜料, 聚二甲基硅氧烷中的 15% 分散体	0.05
SE30 ³ 预混物 - 9.76% SE30 ³ 在 DC200/20 ¹ 中	10.25
DC200/12500 ¹	1.0
DC200/20 ¹	9.2
2-丁酮	3.0
乙酸乙酯	5.0
MQ 树脂 ²	32.5
调味剂	2.0
碳酸氢钠	8.0
氢氧化铝	6.5
热解法二氧化硅	3.5
过碳酸钠	19.0

¹得自 Dow Corning 的聚二甲基硅氧烷

²得自 General Electric 的有机硅氧烷树脂

³得自 General Electric 的聚二甲基硅氧烷胶

10

0.5ml 的液体漂白产品包装在密封小药囊中, 形成单位剂量液体漂白产品。十四个这种单位剂量小药囊和十四个刷子涂敷器被装入展示硬纸

盒，连同一管上表列出的任何一个增白洁齿剂，一起因此形成套盒。硬纸盒还包括用法说明：

1. 在就寝之前，使用你的普通牙刷用附上的增白洁齿剂刷牙
2. 干燥你的牙齿
3. 打开一个液体漂白产品的小药囊
4. 取出一滴液体漂白产品放在所附的刷子涂敷器之一上，并且刷到你的牙齿上
5. 张开口并保持 60 秒，使得形成增白薄膜
6. 让薄膜留在该处过夜，并且在早上像正常一样用增白洁齿剂刷洗掉
7. 每日重复，共十四天

- 5 由于在不背离总特征的前提下，本文所公开的发明可采用其他具体形式来体现，因此本文所描述的实施方案在各方面都仅是说明性的，并且旨在包括由所附的权利要求书指出的本发明的范围，而不是前面所描述的内容，和在与权利要求书等价的含义和范围内的所有实施方案。